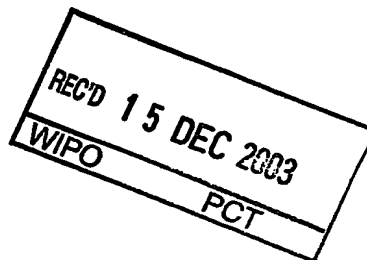


PRIORITY DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH
RULE 17.1(a) OR (b)



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen: 102 39 905.0

Anmeldetag: 30. August 2002

Anmelder/Inhaber: Bayer CropScience GmbH, Frankfurt am Main/DE

Bezeichnung: Substituierte Pyridine oder Pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel

IPC: C 07 D, A 61 K

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 25. März 2003
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

Hiebing

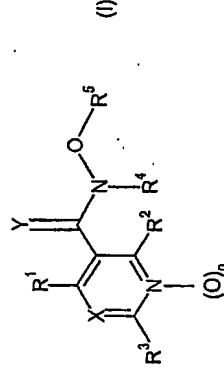
Beschreibung

- 5 Substituierte Pyridine oder Pyrrolidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel
- 10 Die Erfindung betrifft heterocyclische Hydroxamsäurederivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Arthropoden, wie Insekten und Acarina, und Helminthen.
- 15 Wegen des enormen Schadens, den Insekten beispielsweise durch Fraß an Nutzpflanzen, Lebensmittelvorräten, Holz und Textilien oder auch durch Krankheitsübertragung auf Mensch, Haustiere und Nutzpflanzen verursachen, ist die Verwendung von Insektiziden oder Repellentien nach wie vor unverzichtbar. Insektizide sind ein wichtiger Bestandteil der integrierten Schädlingskontrolle und tragen entscheidend zu Ernteertrag und Kontinuität der Ernten in aller Welt bei.
- 20 Aus der WO-A-01/09104 sind Trifluormethylpyrrolidin-Hydroxamsäurederivate als Pestizide bekannt. Die allgemeine Formel der beschriebenen Verbindungen umfasst auch Pyrrolidin-N-acyl-hydroxamsäurederivate. Konkret offenbart werden Pyrrolidin-N-Aryl-acylhydroxamsäurederivate und Pyrrolidin-N-(methyl)benzoyl-hydroxamsäurederivate.
- 25 Da sich die ökologischen und ökonomischen Anforderungen an moderne Insektizide laufend erhöhen, beispielsweise was Toxizität, Selektivität, Aufwandmenge, Rückstandsbildung und günstige Herstellbarkeit angeht, und außerdem z.B. Probleme mit Resistenzen auftreten können, besteht die ständige Aufgabe, neue Insektizide zu entwickeln, die zumindest in Teilbereichen Vorteile gegenüber den bekannten aufweisen.
- 30

Es wurde gefunden, daß Verbindungen der allgemeinen Formel (I), gegebenenfalls auch als Salze, ein gutes Wirkungsspektrum gegenüber tierischen Schädlingen bei gleichzeitig guter Pflanzenverträglichkeit und günstigen toxikologischen Eigenschaften gegenüber Säugetieren und aquatischen Lebewesen aufweisen.

5

Gegenstand der Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I) und deren Salze,



10 wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

X ist =CH- oder =N-;

Y ist =O oder =S;

n ist 0 oder 1;

15 R¹ ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, -S(Halogen)₂ oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

R², R³ sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

20

R⁴ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl oder R⁶, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;

25

R⁵ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl,

(C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl oder R⁷, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können; sind unabhängig voneinander -C(W)R⁸, -C(W)OR⁸, -C(W)SR⁸, -C(W)NR⁸, -C(W)NR⁸-NR⁸, -C(W)NR⁸-NR⁸[C(W)R⁸]₂, -SO₂NR⁸, -SO₂OR⁸, -S(O)R⁸, -S(O)₂R⁸, -PWR⁸ oder -PW(OR⁸)₂;

ist =O, =S, =NOR⁸ oder =NNR⁸₂;

ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₄-C₆)-Cycloalkenyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₄-C₆)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₄-C₆)-Cycloalkenyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₆)-Cycloalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₆)-Cycloalkenyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können und gegebenenfalls zwei Reste R⁸ zusammen ein Ringsystem bilden;

mit der Massgabe, dass mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ eine der für R⁶ oder R⁷ definierten Bedeutungen besitzt, und dass, falls R⁵ -C(=O)R^a ist, wobei R^a (C₁-C₆)-Alkyl oder (C₆-C₁₄)-Aryl bedeutet und wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können, R⁴ Wasserstoff oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiertes (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₆)-Cycloalkenyl, (C₆-C₁₀)-Cycloalkenyl oder R⁶ bedeutet.

25 Bevorzugt haben die Symbole und Indizes in Formel (I) folgende Bedeutungen:

- X ist vorzugsweise =CH-;
 Y ist vorzugsweise =O;
 n ist vorzugsweise 0;
 R¹ ist vorzugsweise (C₁-C₆)-Haloalkyl oder -SF₅, insbesondere ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C₁-C₆)-Alkyl, besonders bevorzugt CF₃, CHF₂ oder CF₂Cl, ganz besonders bevorzugt CF₃;

- R², R³ sind vorzugsweise Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, NH(C₁-C₆)-Alkyl, N(C₁-C₆)₂-Alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff;
 R⁴ ist vorzugsweise Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C₁-C₆)-Alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff oder CH₃, oder R⁶;
 R⁵ ist vorzugsweise (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Alkenyl, (C₃-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl oder (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen oder ganz besonders bevorzugt R⁷, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;
 R⁶ und R⁷ sind vorzugsweise unabhängig voneinander -C(W)R⁸, -C(W)OR⁸, -SO₂OR⁸, -S(O)R⁸, -S(O)₂R⁸, -PWR⁸ oder -PW(OR⁸)₂;
 W ist vorzugsweise =O;
 R⁸ ist gleich oder verschieden vorzugsweise Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.

20 Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), für die die Symbole und Indizes folgende Bedeutung haben:

- X ist =CH-;
 Y ist =O;
 n ist 0,
 R¹ ist -CF₃,
 R² und R³ sind Wasserstoff,
 R⁴ ist Wasserstoff, -C(W)R⁸, -S(O)R⁸ oder -S(O)₂R⁸;
 R⁵ ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Alkenyl, (C₃-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, -C(W)R⁸, -S(O)R⁸ oder -S(O)₂R⁸;

- ∞

330 Die Bezeichnung "Halogen" umfasst Fluor, Chlor, Brom und Iod. Vorzugsweise handelt es sich um Chlor oder um Fluor.

Die Bezeichnung „S(Halogen)₂“ umfasst die Gruppen -S₂, -SBr₂, -SCl₂ und insbesondere -SF₂.

Unter dem Ausdruck "(C₁-C₈)-Alkyl" ist ein unverzweigter oder verzweigter

5 Kohlenwasserstoffrest mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen, wie z.B. der Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, 1-Butyl-, 2-Butyl-, 2-Methylpropyl-, tert.-Butyl-, 1-Pentyl-, 2-Methylbutyl-, 1,1-Dimethylpropyl- oder 1-Hexylrest zu verstehen. Entsprechend ist unter Alkylresten mit einem größeren Bereich an Kohlenstoffatomen ein unverzweigter oder verzweigter gesättigter Kohlenwasserstoffrest zu verstehen, der eine Anzahl an Kohlenstoffatomen enthält, die dieser Bereichsangabe entspricht.

10 Unter "(C₁-C₈)-Haloalkyl" ist eine unter dem Ausdruck "(C₁-C₈)-Alkyl" genannte Alkylgruppe zu verstehen, in der ein oder mehrere Wasserstoffatome durch die gleiche Anzahl gleicher oder verschiedener Halogenatome, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sind, wie die Trifluormethyl-, die 1-Fluorethyl-, die 2,2,2-Trifluorethyl-, die Chlormethyl-, Fluormethyl-, die Difluormethyl- und die 1,1,2,2-Tetrafluorethylgruppe.

15 Unter "(C₁-C₈)-Alkoxy" ist eine Alkoxygruppe zu verstehen, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C₁-C₈)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat. Singemäß sind Alkoxygruppen zu verstehen, die einen größeren Bereich an Kohlenstoffatomen umfassen.

20 Die Bezeichnungen "Alkenyl" und "Alkyl" mit einer vorangestellten Bereichsangabe von Kohlenstoffatomen bedeuten einen geradkettigen oder verzweigten Kohlenwasserstoffrest mit einer dieser Bereichsangabe entsprechenden Kohlenstoffatomzahl, der mindestens eine Mehrfachbindung beinhaltet, wobei sich diese an beliebiger Position des betreffenden ungesättigten Restes befinden kann. "(C₂-C₄)-Alkenyl" steht demnach z.B. für die Vinyl-, Allyl-, 2-Methyl-2-propen- oder 2-Butenyl-Gruppe; "(C₂-C₆)-Alkenyl" steht für die vorstehend genannten Reste sowie z.B. für die Pentenyl-, 2-Methylpentenyl- oder die Hexenyl-Gruppe. "(C₂-C₄)-Alkyl" steht z.B. für die Ethinyl-, Propargyl-, 2-Methyl-2-propin- oder 2-Butinyl-Gruppe.

Unter "(C₂-C₆)-Alkyl" sind die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Pentynyl- oder die 2-Hexinyl-Gruppe und unter "(C₂-C₁₀)-Alkyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Octinyl- oder die 2-Decinyl-Gruppe zu verstehen.

5 "(C₃-C₈)-Cycloalkyl" steht für monocyclische Alkylreste, wie den Cyclopropyl-, Cyclobutyl-, Cyclopentyl-, Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctylrest und für bicyclische Alkylreste, wie den Norbornylrest.

10 Unter dem Ausdruck "(C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl" ist beispielsweise der Cyclopropylmethyl-, Cyclopentylmethyl-, Cyclohexylmethyl-, Cyclohexylethyl- und Cyclohexylbutyl-Rest und unter dem Ausdruck "(C₁-C₈)-Alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkyl beispielsweise der 1-Methyl-cyclopropyl-, 1-Methyl-cyclopentyl-, 1-Methyl-cyclohexyl-, 3-Hexyl-cyclobutyl- und 4-tert.-Butyl-cyclohexyl-Rest zu verstehen.

15 "(C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₈)-alkyloxy" bedeutet eine wie vorstehend definierte Alkoxy-Gruppe, die durch eine weitere Alkoxy-Gruppe substituiert ist, wie z.B. 1-Ethoxyethoxy.

20 Unter "(C₃-C₈)-Cycloalkoxy" oder "(C₃-C₈)-Cycloalkylthio" ist einer der oben angeführten (C₃-C₈)-Cycloalkyl-Reste, der über ein Sauerstoff- oder Schwefelatom verknüpft ist, zu verstehen.

25 "(C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxy" bedeutet z.B. die Cyclopropylmethoxy-, Cyclobutylmethoxy-, Cyclopentylmethoxy-, Cyclohexylmethoxy-, Cyclohexylethoxy- oder die Cyclohexylbutoxy-Gruppe;

Der Ausdruck "(C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkoxy" steht z.B. für die Methylcyclopropyloxy-, Methylcyclobutyloxy- oder die Butylcyclohexyloxy-Gruppe.

30 "(C₁-C₆)-Alkylthio" steht für eine Alkylthiogruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat.

Analog bedeuten "(C₁-C₆)-Alkylsulfinyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfinyl-Gruppe und "(C₁-C₆)-Alkylsulfonyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfonyl-Gruppe.

5

"(C₁-C₆)-Alkylamino" steht für ein Stickstoffatom, das durch ein oder zwei, gleiche oder verschiedene Alkylreste der obigen Definition substituiert ist.

Der Ausdruck "(C₁-C₆)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl" bedeutet eine

Carbamoylgruppe mit einem oder zwei Kohlenwasserstoffresten, die die unter dem

10 Ausdruck "(C₁-C₆-Alkyl)" angegebene Bedeutung haben und die im Fall von zwei Kohlenwasserstoffresten gleich oder verschieden sein können.

Analog bedeutet "(C₁-C₆)-Dihaloalkylcarbamoyl" eine Carbamoylgruppe, die zwei (C₁-C₆)-Haloalkylreste gemäß der obigen Definition oder einen (C₁-C₆)-Haloalkylrest und einen (C₁-C₆)-Alkylrest gemäß der obigen Definition trägt.

15

"(C₁-C₆)-Alkanoyl" steht z.B. für die Formyl-, Acetyl-, Propionyl-, Butyryl- oder 2-Methylbutyryl-Gruppe;

20

Unter dem Ausdruck "(C₆-C₁₄)-Aryl" ist ein carbocyclischer, d.h. aus

Kohlenstoffatomen aufgebauter, aromatischer Rest mit 6 bis 14, insbesondere 6 bis 12 C-Atomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl oder Biphenyl, vorzugsweise Phenyl, zu verstehen.

25

"Aroyl" bedeutet demnach einen wie vorstehend definierter Arylrest, der über eine Carbonyl-Gruppe gebunden ist, wie z.B. die Benzoyl-Gruppe.

Der Ausdruck "(C₃-C₁₀)-Heterocyclyl" steht für einen cyclischen Rest, der drei bis zehn C-Atome aufweist, der vollständig gesättigt, teilweise ungesättigt oder vollständig ungesättigt bzw. aromatisch sein kann und der durch mindestens ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Atome aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel oder Sauerstoff unterbrochen sein kann, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome

30

direkt benachbart sein dürfen und noch mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß, wie z.B. ein Rest von Thiophen, Furan, Pyrrol, Thiazol, Oxazol, Imidazol, Isothiazol, Isoxazol, Pyrazol, 1,3,4-Oxadiazol, 1,3,4-Thiadiazol,

1,3,4-Triazol, 1,2,4-Oxadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, 1,2,3-Triazol,

5

1,2,3,4-Tetrazol, Benzo[b]thiophen, Benzofuran, Indol, Benzo[c]thiophen,

Benzo[c]furan, Isoindol, Benzoxazol, Benzothiazol, Benzimidazol, Benzisoxazol,

- Benzisothiazol, Benzopyrazol, Benzothiadiazol, Benzotriazol, Dibenzofuran,

Dibenzothiophen, Carbazol, Pyridin, Pyrazin, Pyrimidin, Pyridazin, 1,3,5-Triazin,

1,2,4-Triazin, 1,2,4,5-Tetrazin, Chinolin, Isochinolin, Chinoxalin, Chinazolin, Cinnolin,

10

1,8-Naphthyridin, 1,5-Naphthyridin, 1,6-Naphthyridin, 1,7-Naphthyridin, Phthalazin,

Pyridopyrimidin, Purin, Pteridin, 4H-Chinolizin, Piperidin, Pyrrolidin, Oxazolin,

Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Isoxazolidin, Isoxazolin, Thiazolin, Morpholin,

Piperazin, Oxiran, Oxetan oder Thiazolidin. Der Ausdruck "Heteroaromat" umfaßt

demnach von den vorstehend unter "Heterocyclyl" genannten Bedeutungen jeweils

15 die vollständig ungesättigten aromatischen heterocyclischen Verbindungen.

Heterocyclyl bedeutet bevorzugt ein gesättigtes, teilgesättigtes oder aromatisches Ringsystem mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 4 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, wobei mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß.

20

Ganz besonders bevorzugt bedeutet Heterocyclyl ein Radikal des Pyridin, Pyrimidin, (1,2,4)-Oxadiazol, (1,3,4)-Oxadiazol, Pyrrol, Furan, Thiophen, Oxazol, Thiazol,

Imidazol, Pyrazol, Isoxazol, 1,2,4-Triazol, Tetrazol, Pyrazin, Pyridazin, Oxazolin,

Thiazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Morpholin, Piperidin, Piperazin,

25

Pyrrolin, Pyrrolidin, Oxazolidin, Thiazolidin, Oxiran und Oxetan.

"Aryl-(C₁-C₄)-alkoxy" steht für einen über eine (C₁-C₄)-Alkoxygruppe verknüpften

Arylrest, z.B. den Benzyloxy-, Phenylethoxy-, Phenylbutoxy- oder Naphthylmethoxy-Rest.

30

"Arythio" bedeutet einen über ein Schwefelatom verknüpften Arylrest, z.B. den Phenylthio- oder den 1- oder 2-Naphthylthio-Rest. Analog bedeutet "Aryloxy" z.B. den Phenoxy- oder 1- oder 2-Naphthylloxy-Rest.

5 "Aryl-(C₁-C₄)-alkylthio" steht für einen Arylrest, der über einen Alkylthioester verknüpft ist, z.B. der Benzylthio-, Naphthylmethylthio- oder die Phenylethylthio-Rest.

Der Ausdruck "(C₁-C₆)-Trialkylsilyl" bedeutet ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Alkylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen Definition trägt. Analog stehen "Aryl-(C₁-C₆)-Dialkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Arylrest und zwei gleiche oder verschiedene Alkylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen Definition trägt, "Diaryl-(C₁-C₆)-Alkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Alkylrest mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen und zwei gleiche oder verschiedene Arylreste gemäß der obigen Definition trägt, und "Triarylsilyl" für ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Arylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen Definition trägt.

Zu den Substituenten, mit denen die verschiedenen aliphatischen, aromatischen und heterocyclischen Ringsysteme versehen sein können, zählen bevorzugt

20 Halogen, Nitro, Cyano, Di-(C₁-C₄)-alkylamino, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Trialkylsilyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₂)-Alkoxy-[CH₂CH₂]₂₋₈-ethoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Halogenphenoxy, (C₁-C₄)-Alkylthiophenoxy, (C₁-C₄)-Alkoxyphenoxy, (C₄)-Alkylthiophenoxy, Phenylthio, Heterocyclyl, Heterocyclylthio, Heterocycloxy, Halogenheterocycloxy, Alkylheterocycloxy oder Alkoxyheterocycloxy, wobei in den Alkylresten und den davon abgeleiteten Resten eines oder mehrere Wasserstoffatome, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl durch Halogen, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sein können.

30 Besonders bevorzugte Substituenten sind, insbesondere bei cyclischen Systemen, Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-

Haloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylamino, Formyl und (C₁-C₄)-Alkanoyl.

Je nach Art der oben definierten Substituenten weisen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) saure oder basische Eigenschaften auf und können Salze bilden. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Hydroxy, Carboxy oder andere, saure Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Basen zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Basen sind beispielsweise Hydroxide, Carbonate, Hydrogencarbonate der Alkali- und Erdalkalimetalle, insbesondere die von Natrium, Kalium, Magnesium und Calcium, weiterhin Ammoniak, primäre, sekundäre und tertiäre Amine mit (C₁-C₄)-Alkylresten sowie Mono-, Di- und Trialkanolamine von (C₁-C₄)-Alkanolen. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Amino, Alkylamino oder andere, basische Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Säuren zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Säuren sind beispielsweise Mineralsäuren, wie Salz-, Schwefel- und Phosphorsäure, organische Säuren, wie Essigsäure oder Oxalsäure, und saure Salze, wie NaHSO₄ und KHSO₄. Die so erhältlichen Salze weisen ebenfalls Insektizide, akarizide und mitizide Eigenschaften auf.

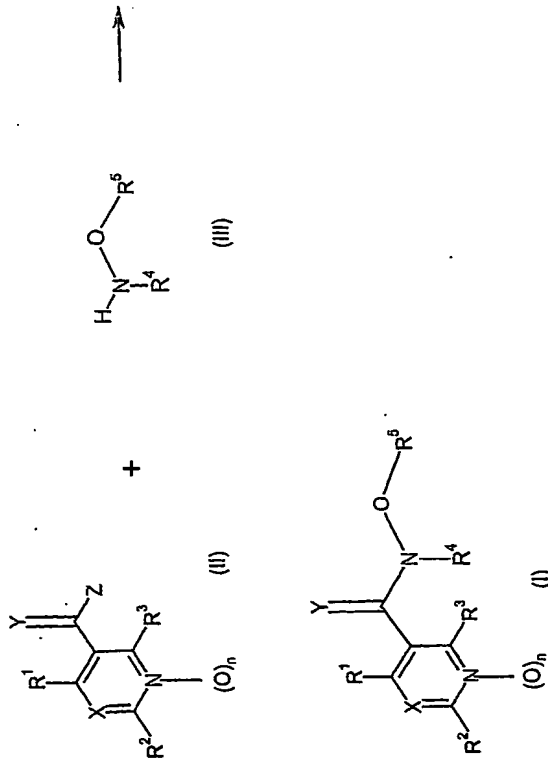
Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können ein asymmetrisches Schwefelatom und/oder eines oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome oder Stereoisomere an Doppelbindungen aufweisen. Es können daher Enantiomere oder Diastereomere auftreten. Die Erfindung umfaßt sowohl die reinen Isomeren als auch deren Gemische. Die Gemische von Diastereomeren können nach gebräuchlichen Methoden, z.B. durch selektive Kristallisation aus geeigneten Lösungsmitteln oder durch Chromatographie in die Isomeren aufgetrennt werden. Racemate können nach üblichen Methoden in die Enantiomeren aufgetrennt werden.

Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen kann unter Reaktionsbedingungen erfolgen, die für die genannten Umsetzungen bekannt und geeignet sind. Dabei kann man auch von an sich bekannten, hier nicht näher erwähnten Varianten

Gebrauch machen. Die Ausgangsstoffe können gewünschtenfalls auch *in situ* gebildet werden, und zwar derart, dass man sie aus dem Reaktionsgemisch nicht isoliert, sondern sofort weiter zu den Verbindungen der Formel (I) umsetzt.

- 5 Hydroxamsäurederivate der allgemeinen Formel (I), worin $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, X, Y$ und n die oben angegebenen Bedeutungen haben, lassen sich aus der Reaktion von aktivierten Säurederivaten der Formel (II) mit Hydroxylaminderivaten der Formel (III) gemäß dem nachfolgenden Schema erhalten. Z in Formel II kann ein Halogen, wie Chlor oder Brom sein.

10



Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auch durch Derivatisierung der unsubstituierten Hydroxamsäure (I; R^4 und R^5 ist Wasserstoff) oder durch Substitution, wenn R^4 oder R^5 Wasserstoff ist, erhalten werden.

15

Allgemeine Vorschriften zur Darstellung von substituierten Hydroxamsäuren findet man in D. Döpp, H. Döpp in Houben-Weyl, 4. Auflage (1984) E5 II, S.1141.

Für die Aktivierung der Säure (II; $Z = \text{Hydroxyl}$) kann die Umsetzung zum Säurehalogenid (II, $Z = \text{Halogenid}$) benutzt werden. Mögliche Halogenierungsreagenzien sind Oxalylchlorid, POCl_3 , PCl_3 , PCl_5 , SOCl_2 oder SO_2Cl_2 .

5

- Die so erhaltenen Säurehalogenide können dann weiter mit Hydroxylamin (III, $R^4, R^5 = \text{Wasserstoff}$) oder auch mit Hydroxylaminderivaten (III) umgesetzt werden (Literatur: Jenks, J. Amer. Chem. Soc. (1958), 80, 4585; Beckmann, Chem. Ber. (1993), 26, 2625). Als typische Methode wird das Säurehalogenid (II; $Z = \text{Halogenid}$) mit Hydroxylaminderivaten (III) in Gegenwart einer Base umgesetzt. Geeignete Basen sind z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate oder organische Basen, wie z.B. Trialkylamine oder Pyridine. Eingesetzt werden können auch Festphasen-gebundene Basen, wie z.B. S-Trisamine von Agilent oder Polystyrene AM NH_2 von Rapp. Die Reaktion wird vorteilhaft in einem inerten Lösemittel, wie z.B. Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Benzol, Toluol, Diethylether oder Tetrahydrofuran oder auch in Gemischen dieser Lösemittel in einem Temperaturbereich zwischen 0°C und 100°C , vorzugsweise 20°C bis 50°C durchgeführt.

10

15

- 20 Alternativ kann die Säure auch direkt unter Zuhilfenahme von Kupplungsreagenzien, wie CDI, DCC oder EDAC mit Hydroxylaminderivaten umgesetzt werden (Literatur: D. Geffken, G. Zimmer, Chem. Ber. (1973) 106, 2246; M. Miller et al., J. Amer. Chem. Soc. (1980), 120, 7026). Möglich ist auch eine direkte Umsetzung der Ester (II, $X = \text{OR}$) mit den Hydroxylaminderivaten (III).

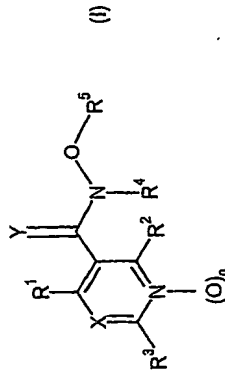
25

Substituierte Hydroxamsäuren, in denen R^5 gleich Wasserstoff ist, können z.B. auch durch Hydrierung mit z.B. Wasserstoff von Verbindungen (I) in denen R^5 ein benzyllischer Substituent ist, erhalten werden.

- 30 Die entstehenden substituierten Hydroxamsäuren (I), in denen R^4 oder R^5 oder R^4 und R^5 gleich Wasserstoff sind, können durch Alkylierung oder Acylierung nach an sich bekannten Methoden (wie z.B. in R.C. Larock, Comprehensive Organic

Transformations, VCH Weinheim beschrieben) in die Zielverbindungen (I) übergeführt werden. Als typische Methode wird die Hydroxamsäure (I, R⁴ oder R⁵ oder R⁴ und R⁵ gleich Wasserstoff) mit Säurechloriden in Gegenwart einer Base umgesetzt. Geeignete Basen sind z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate oder organische Basen, wie z.B. Trialkylamine oder Pyridine. Eingesetzt werden können auch Festphasen-gebundene Basen, wie die oben erwähnten Beispiele. Die Reaktion wird vorteilhaft in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 50°C durchgeführt. Beispiele für inerte Lösungsmittel sind weiter oben aufgeführt.

Die Erfindung betrifft auch ein Verfahren zur Herstellung der oben definierten Verbindungen der Formel (I)



worin R¹, R², R³, R⁴, R⁵, X, Y und n die weiter oben angegebene Bedeutung haben und mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ -C(W)R⁶, -C(W)OR⁶, -C(W)SR⁶, -C(W)NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶[C(W)R⁶], -SO₂NR⁶, -SO₂OR⁶, -S(O)R⁶, -S(O)₂R⁶, -PW₂R⁶ oder -PWR⁶ bedeutet, durch Umsetzung einer Verbindung der Formel (I), worin R⁴ und R⁵ Wasserstoff bedeuten mit einer Verbindung der

Formel IV



worin Hal ein Halogenatom ist und R¹² ein Rest ist, der ausgewählt wird aus der Gruppe bestehend aus -C(W)R⁶, -C(W)OR⁶, -C(W)SR⁶, -C(W)NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶[C(W)R⁶], -SO₂NR⁶, -SO₂OR⁶, -S(O)R⁶, -PWR⁶ oder -PW(OR⁶)₂, worin W und R⁶ die weiter oben definierte Bedeutung besitzen.

Zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), in denen n 1 bedeutet, kann am Pyridin-Stickstoff oxidiert werden (siehe z.B. Houben-Weyl, 4. Auflage (1992), Bd. E 7b, G. Thieme, Stuttgart). Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise organische Persäuren, wie 3-Chlorperbenzoesäure, und Wasserstoffperoxid.

Die Säure der Formel II, worin X -CH= ist und R¹ CF₃ bedeutet, ist als Substanz beschrieben und käuflich, vorz.B. Aldrich erhältlich.

Andere Pyridine wie auch die Pyrimidine werden nach literaturbekannten Methoden hergestellt (D. Spitzner „Methoden der Organischen Chemie“, Houben-Weyl, 4. Auflage (1992) Bd. E 7b, G. Thieme, Stuttgart; M.G. Hoffmann, A. Nowak, M. Müller, Houben-Weyl, 4. Auflage (1998), Bd. E 9b/Part 1).

Die erfindungsgemäßen Verfahren eignen sich vorzugsweise zur parallelisierten Reaktionsdurchführung.

Kollektionen aus Verbindungen der Formel (I), die nach oben genannten Schema synthetisiert werden können, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig

automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte bzw. Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise

verstanden, wie sie beispielsweise durch S.H. DeWitt in "Annual Reports in

Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, Seite 69 bis 77 beschrieben ist.

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, wie sie beispielsweise von den Firmen Stem Corporation, Woodroffe road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, England oder H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Deutschland oder der Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, England,

angeboten werden. Für die parallelierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beziehungsweise von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

5

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständige integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA bezogen werden.

10

Neben den hier beschriebenen kann die Herstellung von Verbindungen der

15

allgemeinen Formel (I) vollständig oder partiell durch Festphasen - unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepassten Synthese an ein Syntheseharz gebunden. Festphasen - unterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998.

20

Die Verwendung von Festphasen-unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisierten ausgeführt werden können. Zum Beispiel kann die

25

"Teelbeutelmethode" (Houghten, US 4,631,211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci., 1995, 82, 5131-5135) mit Produkten der Firma IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA teilweise automatisiert werden. Die Automatisierung von Festphasen unterstützten Parallelsynthesen gelingt beispielsweise durch Apparaturen der Firmen Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA oder MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Deutschland.

30

Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert Verbindungen der Formel (I) in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden.

5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren, Helminthen und Mollusken, ganz besonders bevorzugt zur Bekämpfung von Insekten und Spinnentieren, die in der

10

Landwirtschaft, bei der Tierzucht, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben

15

erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes* ribis, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Paronychus* spp., *Tetranychus* spp., *Eotetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Eutetranychus* spp.. Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20

25 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigereilla immaculata*.

30

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*,
Leucophaea maderae, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp.,
Locusta migratoria migratorioides, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung des Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Pediculus*
humanus corporis, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp..

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* pp., *Damalinea* spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*,
Piesma quadrata, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp..

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*,
Trialeurodes vaporariorum, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus*
ribis, *Doralis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*,
Macrosiphum avenae, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*,
Empoasca spp., *Euscelus bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*,
Saissetia oleae, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*,
Aspidiotus hederarum, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*,
Chelmatobia brumata, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella*
maculipennis, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,
Bucculatrix thurberella, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,
Earlas insulana, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis*
flammea, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*,

30 *Cooperia*, *Chabertia*, *Strongyloides*, *Oesophagostomum*, *Hyosstrongylus*,
Ancylostoma, *Ascaris* und *Heterakis* sowie *Fasciola*.

Pteris spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*,
Cacoecia podana, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysis ambigua*,
Homona magnanima, *Tortrix viridana*.

5 Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*,
Bruchidius obtectus, *Acanthoscelides obtectus*, *Hydroporus bajulus*, *Agelastica alni*,
Leptinotarsa decemlineata, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes*
chrysocephala, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*,
Anthonomus spp., *Sitophilus* spp., *Otiorynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*,
Ceuthorrhynchus assimilis, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma*, *Anthrenus*
spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus*
hololeucus, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,
Conoderus spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra*
zealandica.

15 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Diptiron* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp.,
Monomorium pharaonis, *Vespa* spp..

Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.,
20 *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*,
Lucilia spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hypobosca* spp.,
Stomoxys spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio*
hortulanus, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*,
Dacus oleae, *Tipula paludosa*.

25 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp..

Aus der Ordnung der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

30 Aus der Klasse der Helminthen z.B. *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*,
Cooperia, *Chabertia*, *Strongyloides*, *Oesophagostomum*, *Hyosstrongylus*,
Ancylostoma, *Ascaris* und *Heterakis* sowie *Fasciola*.

Aus der Klasse der Gasropoda z.B. *Deroceras* spp., *Aron* spp., *Lymnaea* spp.,
Galba spp., *Succinea* spp., *Blomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Oncomelania* spp..
 Aus der Klasse der Bivalva z.B. *Dreissena* spp..

-5

Weiterhin lassen sich Protozoen, wie *Eimeria*, bekämpfen.

Zu den pflanzenparasitären Nematoden, die erfindungsgemäß bekämpft werden können, gehören beispielsweise die wurzelparasitären Bodennematoden wie z.B. solche der Gattungen *Meloidogyne* (Wurzelgallennematoden, wie *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne hapla* und *Meloidogyne javanica*), *Heterodera* und *Globodera* (zystenbildende Nematoden, wie *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Heterodera trifolii*) sowie der Gattungen *Radopholus* wie *Radopholus similis*, *Pratylenchus* wie *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans* und *Pratylenchus curvatus*; *Tylenchulus* wie *Tylenchulus semipenetrans*,

Tylenchorhynchus, wie *Tylenchorhynchus dubius* und *Tylenchorhynchus claytoni*, *Rotylenchus* wie *Rotylenchus robustus*, *Helicotylenchus* wie *Helicotylenchus multicinctus*, *Belonoaimus* wie *Belonoaimus longicaudatus*, *Longidorus* wie *Longidorus elongatus*, *Trichodorus* wie *Trichodorus primitivus* und *Xiphinema* wie *Xiphinema index*.

Ferner lassen sich mit den erfindungsgemäßen Verbindungen die Nematodengattungen *Ditylenchus* (Stengelparasiten, wie *Ditylenchus dipsaci* und *Ditylenchus destructor*), *Aphelenchoides* (Blattnematoden, wie *Aphelenchoides ritzemabosi*) und *Anguina* (Blütennematoden, wie *Anguina tritici*) bekämpfen.

Die Erfindung betrifft auch Mittel, beispielsweise Pflanzenschutzmittel, vorzugsweise Insektizide, akarizide, ixodizide, nematizide, molluskizide oder fungizide, besonders bevorzugt Insektizide und akarizide Mittel, die eine oder mehrere Verbindungen der Formel (I) neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

30

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel (I) im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%.

Zur Herstellung der erfindungsgemäßen Mittel gibt man den Wirkstoff und die weiteren Zusätze zusammen und bringt sie in eine geeignete Anwendungsform.

5

Die Erfindung betrifft auch Mittel, insbesondere insektizide und akarizide Mittel, die die Verbindungen der Formel (I) neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

10

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formeln (I) im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%. Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben ist. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher beispielsweise in Frage:

15

Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EC), wäßrige Lösungen (SL), Emulsionen, versprühbare Lösungen, Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC), Suspoemulsionen (SE), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispersierbare Granulate (WG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln, Wachse oder Köder.

20

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hausen Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

25

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel, d.h. Träger- und/oder oberflächenaktive Stoffe, wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v.

30

Ophen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix. Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenol-sulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium enthalten.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzol-sulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanfetsäureester, Polyoxethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit, Pyrophosphat oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch

Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebmitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration üblicherweise etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubbörmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubbörmige und granuliert zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,0005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,001 und 5 kg/ha Wirkstoff.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischungen mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilanzen,

Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen.

Zu den Schädlingsbekämpfungsmitteln zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, Formamidine, Zinnverbindungen und durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe.

Bevorzugte Mischungspartner sind:

- 10 1. aus der Gruppe der Phosphorverbindungen
Acephate, Azamethiphos, Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, Bromophos, Bromophos-ethyl, Cadusafos (F-67825), Chlorethoxyphos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl, Demeton, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methyl sulfon, Dialifos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, Dimethoate, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrifos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfthion, Fenthion, Flupyrzafos, Fonofos, Formothion, Fosthiazate, Heptenophos, Isazophos, Isothioate, Isoxathion, Malathion, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Salithion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Parathion, Parathion-methyl, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosfolan, Phosphocarb (BAS-301), Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Propaphos, Proetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridapenthion, Quinalphos, Sulprofos, Temephos, Terbufos, Tebupirifos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorphon, Vamidothion;

- 25 2. aus der Gruppe der Carbamate
Alanycarb (OK-135), Aldicarb, 2-sec-Butylphenylmethylcarbamate (BPMC), Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Bentfurcarb, Ethiofencarb, Furathiocarb, HCN-801, Isoprocarb, Methomyl, 5-Methyl-n-cumenylbutyl(methyl)carbamate, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, 1-Methylthio(ethylideneamino)-N-methyl-N-(morpholinthio)carbamate (UC 51717), Triazamate;

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

- Acinathrin, Allethrin, Alphamethrin, 5-Benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R)-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, Beta-Cyfluthrin, alpha-Cypermethrin, Beta-Cypermethrin, Bioallethrin, Bioallethrin((S)-cyclopentylisomer), Bioresmethrin, Bifenthrin, (RS)-1-Cyano-1-(6-phenoxy-2-pyridyl)methyl-(1RS)-trans-3-(4-tert.butylphenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (NCI 85193), Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cythifluthrin, Cypermethrin, Cyphenothrin, Deltamethrin, Empenthrin, Esfenvalerate, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flubrocylthrin, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvinalin (D-Isomer), Imiprothrin (S-41311), Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Phenothrin ((R)-Isomer), Prallethrin, Pyrethrine (natürliche Produkte), Resmethrin, Tetfluthrin, Tetramethrin, Theta-Cypermethrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Zeta-Cypermethrin (F-56701);

- 15 4. aus der Gruppe der Amidine
Amitraz, Chlordimeform;

5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen
Cyhexatin, Fenbutatinoxide;

6. Sonstige

- Abamectin, ABG-9008, Acequinocyl, Azadirachtin, Acetamiprid, Anagrapa falcitera, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, AL-9811, ANS-118, Azadirachtin, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, Bensullap, Bifenazate (D-2341), Binapacryl, BJL-932, Bromopropylate, BAJ-2740 (Spirodiclofen), BSN 2060 (Spiromesifen), BTG-504, BTG-505, Buprofezin, Camphechlor, Cartap, Chlorobenzilate, Chlorfenapyr, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Chlorfentazine, Chloproxyfen, Chlothianidine, Chromafenozide (ANS-118), A-184699, Cyclopropanecarbonsäure-(2-naphthylmethyl)ester (Ro12-0470), Cyromazin, CM-002X, DBI-3204, Diaclofen (Thiamethoxam), Diafenthuron, DBI-3204, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-

- propoxyphenyl)-carbamoyl)-2-chlorbenzcarboximid-säureethylester, DDT, Dicofof, Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xyldine, Dihydroxymethyl-dihydroxypyrididin, Dinobuton, Dinocap, Diofenolan, DPX-062, Enamectin-Benzozate (MK-244), Endosulfan, Ethiprole (Sulfethiprole), Ethofenprox, Etoazazole (YI-5301), Fenazaquin, Fenoxycarb, Fipronil, Flonicamid (IKI 220), Fluazuron, Flumite (Flufenzine, SZI-121), 2-Fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl)-4-methyl-1-pentyl)diphenylether (MTI 800), Granulose- und Kempolyederviren, Fenpyroximate, Fenthicarb, Fluacrypyrim, Flufenzine, Flubenzimine, Flubrocrythrinat, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Flufenprox (ICI-A5683), Flufenzine, Fluproxyfen, FMC-F6028, Gamma-HCH, Halofenozide (RH-0345), Halofenprox (MTI-732), Hexaflumuron (DE_473), Hexythiazox, HOI-9004, Hydramethylnon (AC 217300), Lufenuron, L-14165, Imidacloprid, Indoxacarb (DPX-MP062), Kanemite (AKD-2023), M-020, MTI-446, Ivermectin, M-020, IKA-2000, MKI-245, Methoxyfenozide (Intrepid, RH-2485), Milbemecltin, NC-196, Neemgard, Nitenpyram (TI-304), 2-Nitromethyl-4,5-dihydro-6H-thiazin (DS 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,2-thiazinan-3-ylcarbamaldehyde (WL 108477), Novaluron, NC-196, NNJ-0001, Nidintefuran, Propargite, Pyriproxyfen (S-71639), Pirydaryl, Protrifenbutate, Pyriproxyfen, NC-196, NC-1111, NNI-9768, Novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, Propargite, Pymethrozin, Pyridaben, Pyrimidifen (SU-8801), R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, Silafluofen, Silomadine (CG-177), Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, SU-9118, Tebufenozide, Tebufenpyrad (MK-239), Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thiadiprid, Thiocyclam, Thiamethoxam, TI-435, Tolfenpyrad (OMI-88), Triazamate (RH-7988), Triflumuron, Triethoxyspinosyn A, Verbutin, Vertalec (Mykotal), YI-5301 und YI-6101.

Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12. Auflage, British Crop Protection Council Farnham, 2000 beschrieben sind.

Als Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Produkte zu nennen:

- Aldimorph, Andoprime, Anilazine, BAS 480F, BAS 450F, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Bitertanol, Bromiconazol, Buthiobate, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, CGA 173506, Cyproflum, Dichlofluanil, Dichlomezin, Diclbutrazol, Diethofencarb, Difenconazol (CGA 169374), Difluconazole, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazole, Dinocap, Dithianon, Dodemorph, Doline, Edifenfos, Ethirimol, Etridiazol, Fenarimol, Fenfuram, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Ferimzone (TF164); Fluzinam, Fluobenzimine, Flouxastrobil, Fluquinconazole, Fluorimide, Flusilazol, Flutolanil, Fluthafol, Folpet, Fosetylaluminium, Fuberidazole, Fulsulfamide (MT-F 651), Furalaxyl, Furconazol, Fumecycloz, Guazatine, Hexaconazole, ICI A5504, Imazalil, Imibenconazole, Iprobenfos, Iprodione, Isoprothiolane, KNF 317, Kupferverbindungen wie Cu-oxichlorid, Oxine-Cu, Cu-oxide, Mancozeb, Maneb, Mepanpyrim (KIF 3535), Metconazol, Mepronil, Metalaxyl, Methasulfocarb, Methfuroxam, MON 24000, Myclobutanil, Nabam, Nitrothaldopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxyacboxin, Penconazol, Pencycuron, PP 969, Probenazole, Propineb, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propiconazol, Prothiocarb, Pyracarbolid, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyroquilon, Rabenzazole, RH7592, Schwefel, Tebuconazole, TF 167, Thlabendazole, Thicyofen, Thiofanatemethyl, Thiram, Tolclofos-methyl, Tolyfluandil, Triadimefon, Triadimenol, Tricyclazole, Tridemorph, Triflumizol, Triforine, Validamycin, Vinchlozolin, XRD 563, Zineb, Natriumdodecylsulfonat, Natrium-dodecyl-sulfat, Natrium-C13/C15-alkoholethersulfonat, Natrium-cetostearyl-phosphat, Diocetyl-natrium-sulfosuccinat, Natrium-isopropyl-naphthalene-sulfonat, Natrium-methylenbisnaphthalene-sulfonat, Cetyl-trimethylammonium-chlorid, Salze von langkettigen primären, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propyleneamine, Lauryl-pyrimidiniumbromid, ethoxylierte quartäre Fettsäuren, Alkyl-dimethyl-benzyl-ammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkylimidazol.
- Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,00001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten auf dem human- und veterinärmedizinischen Gebiet bzw. auf dem Gebiet der Tierhaltung. Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht hier in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießen (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion.

- 10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können demgemäß auch besonders vorteilhaft zur Behandlung von Warmblütlern, insbesondere in der Viehhaltung (z.B. Rinder, Schafe, Schweine und Geflügel wie Hühner, Gänse usw.) eingesetzt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung werden den Tieren die Verbindungen, gegebenenfalls in geeigneten Formulierungen und gegebenenfalls mit dem Trinkwasser oder Futter oral verabreicht. Da eine Ausscheidung im Kot in wirksamer Weise erfolgt, läßt sich auf diese Weise sehr einfach die Entwicklung von Insekten im Kot der Tiere verhindern. Die jeweils geeigneten Dosierungen und Formulierungen sind insbesondere von der Art und dem Entwicklungsstadium der Nutztiere und auch vom Befallsdruck abhängig und lassen sich nach den üblichen Methoden leicht ermitteln und festlegen. Die Verbindungen können bei Rindern z.B. in Dosierungen von 0,01 bis 1 mg/kg Körpergewicht eingesetzt werden.

- 25 Neben den bisher genannten Applikationsverfahren zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eine hervorragende systemische Wirkung. Die Wirkstoffe können daher auch über Pflanzenteile, unterirdische wie oberirdische (z.B. Wurzel, Stolonen, Stengel, Stamm, Blatt), in die Pflanzen eingebracht werden, wenn die Wirkstoffe in flüssiger oder fester Form auf, in und/oder in die direkte Umgebung der

Pflanze appliziert werden (z.B. Granulate in der Erdapplikation, Applikation in gefluteten Reisfeldern, Staminjektion bei Bäumen, Stengelbandagen bei perenierenden Pflanzen, Stem painting bei z.B. Hopfen).

- 5 Daneben sind die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, die gegebenenfalls in Coformulierung mit Fungiziden in besonderer Weise zur Behandlung von vegetativem und generativem pflanzlichem Vermehrungsmaterial einsetzbar, wie z.B. von Saatgut von beispielsweise Getreide, Gemüse, Baumwolle, Reis, Zuckerrübe und anderen Kultur- und Zierpflanzen, von Zwiebeln, Stecklingen und Knollen weiterer vegetativ vermehrter Kultur- und Zierpflanzen. Die Behandlung hierfür kann vor der Saat bzw. dem Pflanzvorgang erfolgen (z.B. durch spezielle Techniken des 'Seed Coatings', durch Beizung in flüssiger oder fester Form oder als 'Seedbox Treatment'), während des Saatvorgangs bzw. des Pflanzens oder nach dem Saat- bzw. Pflanzvorgang durch spezielle Applikationstechniken (z.B. Saatreihenbehandlung). Die angewandte Wirkstoffmenge kann entsprechend der Anwendung in einem größerem Bereich schwanken. Im allgemeinen liegen die Aufwandsmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche. Die Behandlungsverfahren für pflanzliches Vermehrungsmaterial und das so behandelte
- 10 - pflanzliche Vermehrungsmaterial sind weitere Gegenstände der Erfindung.
- 20 Die Verbindungen der Formel (I) können auch zur Bekämpfung von Schädipflanzen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenz gegenüber bestimmten Pflanzenschutzmitteln, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten, wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen, wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z.B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.
- 25
- 30

Bevorzugt ist die Anwendung in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutzpflanzen, z.B. von Getreide, wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais, oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

-5

Bei der Anwendung in transgenen Kulturen, insbesondere mit Insektenresistenzen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadorganismen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Schädlingsspektrum, das bekämpft werden kann oder veränderte Aufwandsmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können.

10

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) zur Bekämpfung von Schadorganismen in transgenen Kulturpflanzen.

15

Neben lethaler Wirkung auf Schädlingen zeichnen sich die Verbindungen der Formel (I) auch durch einen ausgeprägten Repellenteffekt aus.

Repellent im Sinne der Verbindung ist ein Stoff oder Stoffgemisch, das abwehrend oder vertreibend auf andere Lebewesen, insbesondere Schädlinge und Lästlinge wirkt. Der Begriff umfasst dabei auch Effekte wie den Antifeeding-Effekt, wobei die Nahrungsaufnahme gestört oder verhindert wird (fraßabweisender Effekt), Unterdrückung der Eiablage oder eine Beeinflussung der Populationsentwicklung.

25

Gegenstand der Erfindung ist daher auch die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) zur Erzielung der genannten Effekte, insbesondere bei den in den biologischen Beispielen benannten Schädlingen.

30

Gegenstand der Erfindung ist auch ein Verfahren zur Abwehr oder Vertreibung von Schadorganismen, wobei man eine oder mehrere Verbindungen der Formel (I) an dem Ort ausbringt, von dem die Schadorganismen ferngehalten oder vertrieben werden sollen.

Ausbringen kann im Falle einer Pflanze beispielsweise eine Behandlung der Pflanze aber auch des Saatguts bedeuten.

5

Es ist, was die Beeinflussung von Populationen angeht von Interesse, daß die Effekte auch hintereinander bei der Entwicklung einer Population beobachtet werden, wobei sie sich aufaddieren können. Hierbei kann der Einzeleffekt selbst nur einen Wirkungsgrad deutlich unter 100 %ige haben und insgesamt am Ende doch eine 100 % Wirkung erreicht werden.

10

Außerdem zeichnen sich die Verbindungen der Formel (I) dadurch aus, daß man – will man die oben angeführten Effekte ausnutzen – zu einem früheren Zeitpunkt als bei einer direkten Bekämpfung üblich das Mittel appliziert. Der Effekt hält häufig lange Zeit an, so daß eine Wirkungsdauer von mehr als 2 Monaten erreicht wird.

15

Die Effekte treten bei Insekten, Spinnentieren und den anderen der oben erwähnten Schädlinge auf.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen beinhaltet neben direkter Applikation auf die Schädlinge jede andere Applikation, bei der Verbindungen der Formel (I) auf die Schädlinge wirken. Solche indirekten Applikationen können beispielsweise in der Anwendung von Verbindungen liegen, die, beispielsweise im Boden, der Pflanze oder dem Schädling, zu Verbindungen der Formel (I) zerfallen oder abgebaut werden.

25

Die nachfolgenden Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung.

Chemische Beispiele

Beispiel 1:



5

0,25 g (0,0012 mol) 4-Trifluormethyl-nikotinhydroxamsäure wurden in 10 ml Dichlormethan gelöst. 0,17 ml (0,0012 mol) Triethylamin wurden dazugegeben und die Reaktionsmischung 5 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurden 0,13 ml (0,0012 mol) Iso-Butyrolchlorid gelöst in 3 ml Dichlormethan tropfenweise dazugegeben und die Lösung dann 2 Stunden lang bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktion wurde aufgearbeitet durch Zugabe von Wasser und Extraktion mit Dichlormethan. Nach Trocknen über MgSO_4 wurde filtriert und das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt 0,35 g eines hellen Öls. Dieses wurde gereinigt über Chromatographie mit Heptan und Essigester. Ausbeute: 0,2 g (58%) helles Öl.

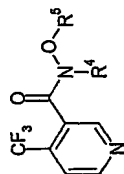
15

^1H NMR 300MHz (CDCl_3): 9,38 (br s 1H NH), 8,90 (m, 2H, 2-H Pyridin), 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin), 2,84 (m, 1H, CH), 1,32 (m, 6H, CH_3)

20

In analoger Weise können die in den nachfolgenden Tabellen aufgeführten Verbindungen hergestellt werden.

Tabelle 1



5

| Beispiel Nr. | R ⁴ | R ⁵ | Bemerkung |
|--------------|----------------------------------|--|-------------------|
| 1 | H | -CO-CH(CH_3) ₂ | Öl |
| 2 | -CO-(4-trifluormethylpyrid-3-yl) | -CH ₃ | Öl |
| 3 | -CO-(4-trifluormethylpyrid-3-yl) | -C ₂ H ₅ | Öl |
| 4 | H | -CO-CH ₂ -O-C ₆ H ₅ | Öl; ¹⁾ |
| 5 | -CO-(2-methoxyphenyl) | -CO-(2-methoxyphenyl) | Öl; ²⁾ |
| 6 | H | -CO-(2-chlorphenyl) | Öl; ³⁾ |
| 7 | -CO-(2-chlorphenyl) | -CO-(2-chlorphenyl) | Öl |
| 8 | H | -CO-(2-chlorphenyl) | Öl; ⁴⁾ |
| 9 | H | -CO-tert-Butyl | Öl |
| 10 | -CO-cyclopropyl | -CO-cyclopropyl | Öl |
| 11 | -CO-CH=CH-CH ₃ | -CO-CH=CH-CH ₃ | Öl |
| 12 | H | -CO-(4-methylphenyl) | Öl; ⁵⁾ |
| 13 | -CO-phenyl | -CO-phenyl | Öl; ⁶⁾ |
| 14 | -CO-CH ₃ | -CO-CH ₃ | Öl; ⁷⁾ |
| 15 | H | -CO-CH ₃ | Öl |

¹⁾ ^1H NMR 300MHz (CDCl_3): 9,72 (br s 1H NH); 8,99 (m, 1H, 2-H Pyridin); 8,61 (s, 1H, 6-H Pyridin); 7,54 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 7,36 (tr, J=8Hz, 2H, 3', 5' H Phenyl); 7,08 (tr, J=8Hz, 1H, 4' H Phenyl); 6,99 (tr, J=8Hz, 2H, 2', 6' H Phenyl); 4,68 (s, 2H, CH_2)

10

²⁾ ^1H NMR 300MHz (CDCl_3): 9,06 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,84 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 7,65 (dd, J=6/2Hz, Phenyl); 7,32-7,52 (m, 3H, Phenyl); 6,80-6,96 (m, 3H, Phenyl); 6,82 (d, J=8Hz, 1H, Phenyl); 3,84 (s, 3H, CH_3); 3,79 (s, 2H, CH_2)

15

³⁾ ^1H NMR 300MHz (CDCl_3): 8,99 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,83 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,12 (m, 1H, 6'-H Phenyl); 7,61 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,24 (m, 1H, 3'H Phenyl); 7,08 (m, 1H, 5'H Phenyl)

20

⁴) ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 8,94 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,88 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,08 (m, 1H, 6'-H Phenyl); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,51 (m, 2H, 4', 5'H Phenyl); 7,39 (m, 4H, 2', 6'H Phenyl)

5 ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,92 (br s, 1H, NH); 8,96 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,90 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,02 (m, 2H, Phenyl); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,30 (m, 2H, Phenyl); 2,44 (s, 3H, CH₃)

10 ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,38 (br s, 1H, NH); 8,90 (m, 2H, 6-H, 2-H Pyridin); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 2,84 (m, 1H, CH); 1,32 (s, 6H, CH₃)

⁷) ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 8,98 (d, J=6Hz; 1H, 6-H Pyridin); 8,63 (s, 1H, 2-H Pyridin); 7,61 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 2,40 (s, 3H, CH₃); 2,20 (s, 3H, CH₃)

15 B. Formulierungsbeispiele

a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

20 b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiemittel mischt und in einer Stifmühle mahlt.

25 c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobornsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexan als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 EO) als Emulgator.

5 e) Ein Granulat läßt sich herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30 % und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig. Dabei beträgt der Gewichtsanteil des Spritzpulvers ca. 5 % und der des inerten Trägermaterials ca. 95 % des fertigen Granulats.

C. Biologische Beispiele

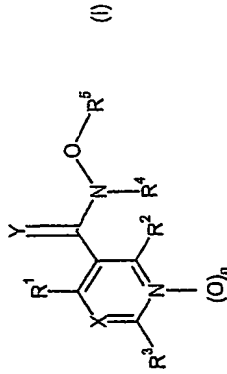
15 In den folgenden Beispielen werden Verbindungen als aktiv angesehen, wenn sie bei einer Konzentration von 500 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) oder weniger eine Wirkung auf die Schadorganismen von 50% oder mehr aufweisen.

20 Angekeimte Ackerbohnen-Samen (*Vicia faba*) mit Keimwurzelin wurden in mit Leitungswasser gefüllte Braunglasflaschen übertragen und anschließend mit ca. 100 schwarzen Bohnenblattläusen (*Aphis fabae*) belegt. Pflanzen und Blattläuse wurden dann für 5 Sekunden in eine wäßrige Lösung des zu prüfenden und formulierten Präparates getaucht. Nach dem Abtropfen wurden Pflanze und Tiere in einer Klimakammer gelagert (16 Stunden Licht/Tag, 25°C, 40-60% RF). Nach 3 und 6 Tagen Lagerung wurde die Mortalität des Präparates auf die Blattläuse festgestellt.

25 Die Verbindungen gemäß der folgenden Beispiele waren aktiv: 1, 2, 5 bis 11, 13 bis 15.

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze,



wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

- X ist =CH- oder =N-;
 Y ist =O oder =S;
 n ist 0 oder 1;
 R¹ ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, -S(Halogen)₂ oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;
 R², R³ sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;
 R⁴ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkynyl, (C₈-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl oder R⁶, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;
 R⁵ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkynyl, (C₈-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl oder R⁷, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;

R⁶, R⁷ sind unabhängig voneinander -C(W)R⁸, -C(W)OR⁸, -C(W)SR⁸, -C(W)NR⁸, -C(W)NR⁸-NR⁸, -C(W)NR⁸-NR⁸[C(W)R⁸], -SO₂NR⁸, -SO₂OR⁸, -S(OR⁸), -S(O)₂R⁸, -PWR⁸ oder -PW(OR⁸)₂;

W ist =O, =S, =NOR⁸ oder =NNR⁸;
 R⁸ ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl,

- (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₄-C₆)-Cycloalkenyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können und gegebenenfalls zwei Reste R⁸ zusammen ein Ringsystem bilden;
 mit der Maßgabe, dass mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ eine der für R⁶ oder R⁷ definierten Bedeutungen besitzt, und dass, falls R⁵ -C(=O)R⁸ ist, wobei R⁸ (C₁-C₆)-Alkyl oder (C₈-C₁₄)-Aryl bedeutet und wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können, R⁴ Wasserstoff oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiertes (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkynyl oder R⁸ bedeutet.

2. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin X =CH- ist.
 3. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin Y =O ist.
 4. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin n = 0 ist.

5. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R¹ (C₁-C₆)-Haloalkyl, insbesondere ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C₁-C₆)-Alkyl ist.
6. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 5, worin R¹ CHF₂, CF₂Cl oder vorzugsweise CF₃ ist.
7. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R¹ -SF₅ ist.
8. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R² und R³ Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, NH(C₁-C₆)-Alkyl oder N(C₁-C₆)-Alkyl bedeuten.
9. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 8, worin R² und R³ Wasserstoff sind.
10. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R⁴ Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C₁-C₆)-Alkyl oder R⁶ bedeutet.
11. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R⁵ (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Alkenyl, (C₃-C₆)-Alkinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl oder (C₃-C₁₀)-Heterocycl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen oder ganz besonders bevorzugt R⁷ bedeutet, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
12. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R⁵ und R⁷ unabhängig voneinander -C(W)R⁶, -C(W)OR⁶, -SO₂OR⁶, -S(O)R⁶, -S(O)₂R⁶, -P(W)R⁶₂ oder -P(W)(OR⁶)₂ bedeuten, W = O ist und R⁶ gleich oder verschieden (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder

Schwefelringatomen ist, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.

13. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:
- X ist =CH-,
Y ist =O;
n ist 0,
R¹ ist -CF₃,
R² und R³ sind Wasserstoff,
R⁴ ist Wasserstoff, -C(W)R⁶, -S(O)R⁶ oder -S(O)₂R⁶,
R⁵ ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₃-C₆)-Alkenyl, (C₃-C₆)-Alkinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, -C(W)R⁶, -S(O)R⁶ oder -S(O)₂R⁶, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
14. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 13, worin die Symbole und Indizes folgende Bedeutung haben:
- R⁴ ist -C(W)R⁶ und insbesondere Wasserstoff;
R⁵ ist -C(W)R⁶, und
R⁶ ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocycl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
15. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, wobei die Substituenten an den Resten R⁴, R⁵ und R⁶ Gruppen R⁹ mit der folgenden Bedeutung sind:
- R⁹ ist gleich oder verschieden R¹⁰ oder zwei Reste R⁹ bilden zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, ein drei- bis achtgliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls mit einem oder mehreren Resten R¹⁰

O. N. S. SO und/oder SO₂, enthält;

O. N. S. SO und/oder SO₂, enthält;

 R^{10} ist gleich oder verschieden R^8, R^{11} ,
$$\begin{aligned} & -C(W)NR^2, -OC(W)R^2, -OC(W)OR^2, -OC(W)SR^2, -OC(W)NR^2, -SC(W)R^2, \\ & -SC(W)OR^2, -SC(W)SR^2, -SC(W)NR^2, -NR^2C(W)R^2, -N[C(W)R^2]_2, \\ & -NR^2C(W)OR^2, -NR^2C(W)SR^2, -C(W)NR^2, -NR^2C(W)R^2, \\ & -NR^2C(W)NR^2, -NR^2NR^2C(W)R^2, -NR^2N[C(W)R^2]_2, -N[(CW)R^2]NR^2, \\ & -NR^2[(CW)NR^2]_2, -NR^2(C=NR^2)R^2, -NR^2(C=NR^2)NR^2, -O-NR^2, -O- \\ & NR^2(CW)R^2, -SO_2NR^2, -NR^2SO_2R^2, -SO_2OR^2, -OSO_2R^2, -OR^2, -NR^2, -SR^2, \\ & -SiR^3, -PR^2, -P(W)R^2, -SOR^2, -SO_2R^2, -PWR^2 \text{ oder } -PW(OR^2)_2; \\ & \text{oder zwei Reste } R^{10} \text{ sind zusammen (W), (=N-R^6), (=CR^2), (=CHR^2), oder} \\ & \text{(=CH}_2\text{):} \end{aligned}$$

W und R^8 besitzen die Definitionen gemäß Anspruch 1,

R¹¹ ist gleich oder verschieden Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Thio, Amino,

Formyl (C_1-C_2)-Alkanyl (C_3-C_6)-Alkoxy, (C_3-C_6)-Alkenyloxy, (C_3-C_6)-

Alkylalkoxy (C_1 - C_{10})-Halogenalkoxy (C_1 - C_{10})-Haloalkenylalkoxy, (C_3 - C_6)-

1,1-бис(4-хлорфенил)этан (C₁₂H₁₀Cl₂)

Haloalkinyloxy, (C_3-C_8 -cycloalkoxy), (C_4-C_6) cycloalkenylaryloxy; (C_3-C_6) haloalkenyloxy; (C_3-C_7) haloalkynylalkenyl; (C_3-C_9) haloalkenylalkenyl; (C_3-C_{10}) haloalkenylalkenyl; (C_3-C_{10}) haloalkenylalkenyl;

[illegible][illegible][illegible]

Cyclopalkoxy, ($\text{C}_2\text{-C}_6$)-Alkenyl-($\text{O}_2\text{-C}_8$) Cycloalkoxyl ($\text{C}_2\text{-C}_{10}$) Alkyl-, ($\text{C}-\text{C})$ -Allyl-, ($\text{C}-\text{C})$ -Vinyl-, ($\text{C}-\text{C})$ -Cyclopalkenyl-oxy (C^n-C^m -) Alkenyl-, (C^n-C^m -)

$$\text{Cycloalkox}, (\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-Alkox} = \text{cycloalkoxy}, \{\text{C}_2-\text{C}_6\}$$

 $\text{Cycloalkylcarboxy}, (\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-Alkylcarboxy}, (\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-Alkylcarboxy} =$ [illegible]

oder Dikalcalculcarbamoyl (C₂-C₂)=Mono- oder Dicycloallylcarbamoyl, Alkylallyloxy, Carbamoylyl, (C₂-O₂)-mono oder Diallylcarbamoylyl (C₂-O₂).

1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17,18,19,20,21,22,23,24,25,26,27,28,29,30,31,32,33,34,35,36,37,38,39,40,41,42,43,44,45,46,47,48,49,50,51,52,53,54,55,56,57,58,59,60,61,62,63,64,65,66,67,68,69,70,71,72,73,74,75,76,77,78,79,80,81,82,83,84,85,86,87,88,89,90,91,92,93,94,95,96,97,98,99,100,101,102,103,104,105,106,107,108,109,110,111,112,113,114,115,116,117,118,119,120,121,122,123,124,125,126,127,128,129,130,131,132,133,134,135,136,137,138,139,140,141,142,143,144,145,146,147,148,149,150,151,152,153,154,155,156,157,158,159,160,161,162,163,164,165,166,167,168,169,170,171,172,173,174,175,176,177,178,179,180,181,182,183,184,185,186,187,188,189,190,191,192,193,194,195,196,197,198,199,200,201,202,203,204,205,206,207,208,209,210,211,212,213,214,215,216,217,218,219,220,221,222,223,224,225,226,227,228,229,230,231,232,233,234,235,236,237,238,239,240,241,242,243,244,245,246,247,248,249,250,251,252,253,254,255,256,257,258,259,260,261,262,263,264,265,266,267,268,269,270,271,272,273,274,275,276,277,278,279,280,281,282,283,284,285,286,287,288,289,290,291,292,293,294,295,296,297,298,299,300,301,302,303,304,305,306,307,308,309,310,311,312,313,314,315,316,317,318,319,320,321,322,323,324,325,326,327,328,329,330,331,332,333,334,335,336,337,338,339,340,341,342,343,344,345,346,347,348,349,350,351,352,353,354,355,356,357,358,359,360,361,362,363,364,365,366,367,368,369,370,371,372,373,374,375,376,377,378,379,380,381,382,383,384,385,386,387,388,389,390,391,392,393,394,395,396,397,398,399,400,401,402,403,404,405,406,407,408,409,410,411,412,413,414,415,416,417,418,419,420,421,422,423,424,425,426,427,428,429,430,431,432,433,434,435,436,437,438,439,440,441,442,443,444,445,446,447,448,449,450,451,452,453,454,455,456,457,458,459,460,461,462,463,464,465,466,467,468,469,470,471,472,473,474,475,476,477,478,479,480,481,482,483,484,485,486,487,488,489,490,491,492,493,494,495,496,497,498,499,500,501,502,503,504,505,506,507,508,509,510,511,512,513,514,515,516,517,518,519,520,521,522,523,524,525,526,527,528,529,530,531,532,533,534,535,536,537,538,539,540,541,542,543,544,545,546,547,548,549,550,551,552,553,554,555,556,557,558,559,560,561,562,563,564,565,566,567,568,569,570,571,572,573,574,575,576,577,578,579,580,581,582,583,584,585,586,587,588,589,590,591,592,593,594,595,596,597,598,599,600,601,602,603,604,605,606,607,608,609,610,611,612,613,614,615,616,617,618,619,620,621,622,623,624,625,626,627,628,629,630,631,632,633,634,635,636,637,638,639,640,641,642,643,644,645,646,647,648,649,650,651,652,653,654,655,656,657,658,659,660,661,662,663,664,665,666,667,668,669,670,671,672,673,674,675,676,677,678,679,680,681,682,683,684,685,686,687,688,689,690,691,692,693,694,695,696,697,698,699,700,701,702,703,704,705,706,707,708,709,710,711,712,713,714,715,716,717,718,719,720,721,722,723,724,725,726,727,728,729,730,731,732,733,734,735,736,737,738,739,740,741,742,743,744,745,746,747,748,749,750,751,752,753,754,755,756,757,758,759,760,761,762,763,764,765,766,767,768,769,770,771,772,773,774,775,776,777,778,779,780,781,782,783,784,785,786,787,788,789,790,791,792,793,794,795,796,797,798,799,800,801,802,803,804,805,806,807,808,809,810,811,812,813,814,815,816,817,818,819,820,821,822,823,824,825,826,827,828,829,830,831,832,833,834,835,836,837,838,839,840,841,842,843,844,845,846,847,848,849,850,851,852,853,854,855,856,857,858,859,860,861,862,863,864,865,866,867,868,869,870,871,872,873,874,875,876,877,878,879,880,881,882,883,884,885,886,887,888,889,890,891,892,893,894,895,896,897,898,899,900,901,902,903,904,905,906,907,908,909,910,911,912,913,914,915,916,917,918,919,920,921,922,923,924,925,926,927,928,929,930,931,932,933,934,935,936,937,938,939,940,941,942,943,944,945,946,947,948,949,950,951,952,953,954,955,956,957,958,959,960,961,962,963,964,965,966,967,968,969,970,971,972,973,974,975,976,977,978,979,980,981,982,983,984,985,986,987,988,989,990,991,992,993,994,995,996,997,998,999,1000,1001,1002,1003,1004,1005,1006,1007,1008,1009,1010,1011,1012,1013,1014,1015,1016,1017,1018,1019,1020,1021,1022,1023,1024,1025,1026,1027,1028,1029,1030,1031,1032,1033,1034,1035,1036,1037,1038,1039,1040,1

[illegible][illegible][illegible][illegible][illegible]

Cycloalkylthio ((C₃-C₈)-Halocycloalkylthio, (C₃-C₈)-Halocycloalkythio, (C₄-C₈)-Halocycloalkythio, (C₃-C₈) Halocycloalkylthio) (C₃-C₈)-Halocycloalkylthio, (C₃-C₈)-Halocycloalkythio, (C₄-C₈)-Halocycloalkythio, (C₃-C₈) Halocycloalkylthio)

cytotoxicity (0.4% of cells were dead).

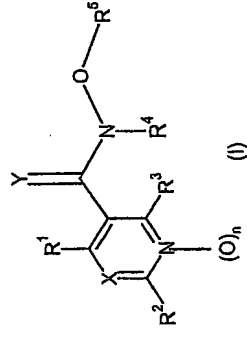
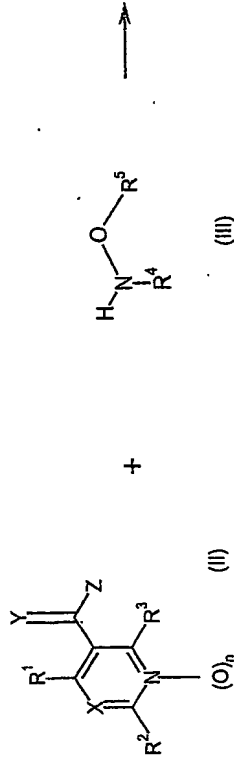
[illegible]

Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₁-C₆)-Trialkylsilyl, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-(C₁-C₄)-Alkoxy, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenyloxy, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylthio, Aryl-(C₂-C₄)-Alkenylthio, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylamino, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenylamino, Aryl-(C₁-C₆)-Dialkylsilyl, Diaryl-(C₁-C₆)-Alkylsilyl, Triarylsilyl und 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, wobei der cyclische Teil der vierzehn letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₆)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylamino, Formyl und (C₁-C₄)-Alkanoyl substituiert ist.

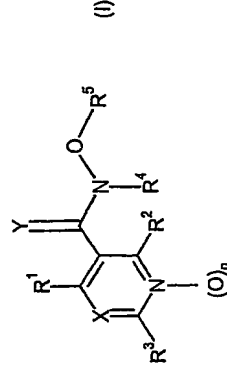
10

16. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1 umfassend die Umsetzung von aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel (II) ist mit Hydroxylaminderivaten der Formel (III), worin R¹, R², R³, R⁴, R⁵, X, Y und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben

15

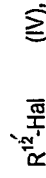


17. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1



5 worin R¹, R², R³, R⁴, R⁵, X, Y und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ -C(W)R⁶, -C(W)OR⁶, -C(W)SR⁶, -C(W)NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶, -C(W)NR⁶-NR⁶[C(W)R⁶], -SO₂NR⁶, -SO₂OR⁶, -S(O)R⁶, -S(O)₂R⁶, -PWR⁶ oder -PW(OR⁶)₂ bedeutet, umfassend die Umsetzung einer Verbindung der Formel (I), worin R⁴ und R⁵ Wasserstoff bedeuten mit einer

10 Verbindung der Formel IV



worin Hal ein Halogenatom ist und R¹² ein Rest ist, der ausgewählt wird aus der Gruppe bestehend aus -C(W)R⁶, -C(W)OR⁶, -C(W)SR⁶, -C(W)NR⁶, -C(W)NR⁶-

15

NR^8 , $-\text{C}(\text{W})\text{NR}^8$, $\text{NR}^8[\text{C}(\text{W})\text{R}^8]_1$, $-\text{SO}_2\text{NR}^8$, $-\text{SO}_2\text{OR}^8$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^8$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^8$, $-\text{PWR}^8$
oder $-\text{PW}(\text{OR}^8)_2$, worin W und R⁸ die in Anspruch 1 definierte Bedeutung besitzen.

18. Mittel mit Insektizider, akarizider, ixodizider, nematizider, molluskizider
und/oder fungizider Wirkung gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens
einer Verbindung der Formel (I) oder eines ihrer Salze nach Anspruch 1.

19. Mittel nach Anspruch 18, dadurch gekennzeichnet, daß es einen weiteren
Wirkstoff aus der Gruppe Akarizide, Fungizide, Herbizide, Insektizide, Nematizide
oder wachstumsregulierende Stoffe enthält.

20. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch
1 zur Herstellung eines Pflanzenschutzmittels, bevorzugt eines insektiziden und/oder
akariziden Pflanzenschutzmittels.

21. Verfahren zur Bekämpfung von Schadorganismen in transgenen
Kulturpflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die transgenen Kulturpflanzen
mit einer wirksamen Menge der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach
Anspruch 1 behandelt.

22. Verfahren zur Abwehr oder Vertreibung von Schädlingen und/oder Lästlingen
von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen mit einer wirksamen
Menge der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch 1
behandelt.

23. Verfahren zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten bei Warmblütlern,
dadurch gekennzeichnet, dass man die Warmblütler mit einer wirksamen Menge der
Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch 1 behandelt.

24. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch
1 zur Bekämpfung von Schadorganismen in transgenen Kulturpflanzen.

25. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch
1 zur Abwehr oder Vertreibung von Schädlingen und/oder Lästlingen von Pflanzen.

26. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch
1 zur Herstellung eines Arzneimittels, insbesondere eines Tierarzneimittels.

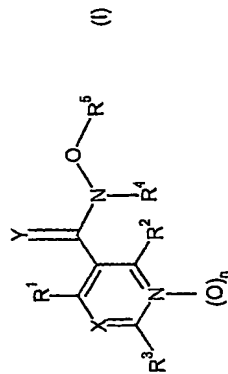
27. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch
1 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Bekämpfung von von Endo- und
Ektoparasiten.

Zusammenfassung

Substituierte Pyridine oder Pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel

5

Beschrieben werden Verbindungen der Formel (I)



10

wobei die Symbole und Indizes die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben.

Diese eignen sich zur Bekämpfung von Schädlingen.

15

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☒ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☒ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☒ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.